



## DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITE DE COOPERATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

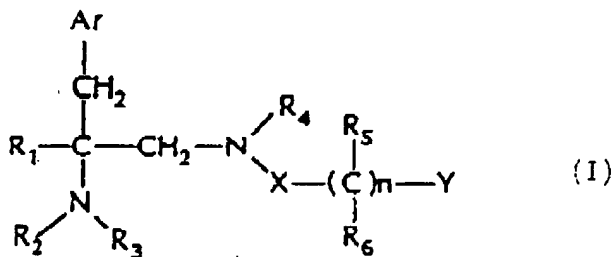
(51) Classification internationale des brevets $\Sigma$ : C07C 233/40, A61K 31/16 C07C 233/37, 233/36, 211/27 A61K 31/135, C07D 295/125 A61K 31/535, C07D 207/325 A61K 31/40	A1	(11) Numéro de publication internationale: WO 93/2227  (43) Date de publication internationale: 11 novembre 1993 (11.11.93)
(21) Numéro de la demande internationale: PCT/CH93/00106 (22) Date de dépôt international: 22 avril 1993 (22.04.93)	(74) Mandataires: DOUSSE, Blasco etc. ; 7, route de Drize, CH-1227 Carouge (CH).	
(30) Données relatives à la priorité: 1365/92-0 28 avril 1992 (28.04.92) CH	(81) Etats désignés: AU, CA, JP, US, brevet européen (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).	
(71) Déposant (pour tous les Etats désignés sauf US): BATTELLE MEMORIAL INSTITUTE [US/CH]; 7, route de Drize, CH-1227 Carouge (CH).	Publiée Avec rapport de recherche internationale.	
(72) Inventeur; et (75) Inventeur/Déposant (US seulement): ROCHER, Jean-Philippe [FR/FR]; 21, rue Maryse-Bastie, F-74240 Gaillard (FR).		

(54) Title: DIAMINE DERIVATIVES HAVING SELECTIVE AFFINITY FOR SIGMA RECEPTORS

(54) Titre: DERIVES DIAMINES AYANT UNE AFFINITE SELECTIVE POUR LES RECEPTEURS SIGMA

## (57) Abstract

Diamine derivatives of formula (I), wherein  $n = 0-8$ ;  $R_1$  is hydrogen or a  $C_{1-3}$  alkyl residue; each of  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$  and  $R_6$  is hydrogen, a  $C_{1-6}$  alkyl residue, branched  $C_{4-12}$  alkyl or alkenyl;  $R_2$  and  $R_3$  together may form a  $C_{3-8}$  ring optionally including a heteroatom and optionally partially or wholly unsaturated;  $R_5$  and  $R_6$  taken together may form a  $C_{2-8}$  ring; X is a single bond,  $-CH_2-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-S(O)-$ , or  $-S(O)_2-$ ; Y is an alkyl residue, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, adamantyl, optionally substituted phenyl or an aromatic heterocyclic ring. Said derivatives are psychotropic agents particularly suitable for treating psychotic disorders, convulsion, dyskinesia, brain distress (ischaemia, hypoxia) and anxiety, and further have anti-inflammatory properties.



## (57) Abrégé

L'invention concerne des dérivés diaminés de formule (I) dans laquelle:  $n = 0$  à  $8$ ;  $R_1$  représente un hydrogène ou un reste alkyle de  $C_1$  à  $C_3$ ;  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$  et  $R_6$  représentent indépendamment un hydrogène, un reste alkyle (1 à 6 C), alkyle ramifié (4-12 C), alkenyle;  $R_2$  et  $R_3$  pris ensemble peuvent former un cycle (3 à 8 C) pouvant inclure un hétéroatome et pouvant être partiellement ou totalement insaturé;  $R_5$  et  $R_6$  pris ensemble peuvent former un cycle (2 à 8 C); X représente une liaison simple,  $-CH_2-$ ,  $-C(=O)-$ ,  $-S(O)-$ ,  $-S(O)_2-$ ; Y est un reste alkyle, cycloalkyle, cycloalkylalkyle, adamantyle, phényle substitué ou non ou un hétérocycle aromatique; Ar est un radical phényle substitué ou non, naphthyle ou un hétérocycle aromatique; ces dérivés sont des psychotropes plus particulièrement indiqués dans les troubles psychotiques, les convulsions, les dyskinesies, les souffrances cérébrales (ischémie, hypoxie) et l'anxiété. Ils possèdent également des propriétés anti-inflammatoires.

FORM PTO-1449 (REV. 2-82)	U.S. DEPARTMENT OF COMMERCE PATENT AND TRADEMARK OFFICE	Atty. Docket No. 1103326-0590	Serial No. 09/381,055
INFORMATION DISCLOSURE STATEMENT BY APPLICANT		Applicant: Asghar et al.	
		Filing Date: September 13, 1999	Group: To be assigned

## UNITED STATES PATENT DOCUMENTS

*Examiner Initial	Document No.							Date	Name	Class	Sub-Class	Filing Date, if Appropriate
	5	5	3	8	9	9	3	7/23/96	Mechoulam et al.			
	5	6	3	5	5	3	0	6/3/97	Mechoulam et al.			

## FOREIGN PATENT DOCUMENTS

*Examiner Initial	Document No.							Date	Country	Class	Sub-Class	Translation Yes No	
	0	6	1	5	7	4	9	9/21/94	EP				
	0	2	7	9	9	3	7	8/31/88	EP				
	9	3	2	2	2	7	9	11/11/93	WO				
	9	7	0	9	3	1	7	3/13/97	WO				
	9	7	1	4	4	1	5	4/24/97	WO				

## OTHER DOCUMENTS (including Author, Title, Date, Pertinent Pages, Etc.)

A	de la Torre et al, Current Therapeutic Research 38, 661-669 (1985).
B	Neugebauer et al, NeuroReport 4, 1259-1262 (1993).

Examiner:

Date Considered:

\*Examiner: Initial citation considered, whether or not citation is in conformance with MPEP 609; Draw line through citation if not in conformance and not considered. Include copy of this form with next communication to applicant.